

貯 法：遮光・室温保存  
使用期限：3年（使用期限の年月は外箱に記載されています。）

	25	50	100
承認番号	4AMY199	4AMY202	4AMY203
薬価収載	1992年7月	1992年7月	1992年7月
販売開始	1992年7月	1992年7月	1992年7月
国際誕生	1991年10月	1991年10月	1991年10月
再審査結果	2005年3月	2005年3月	2005年3月

劇薬，処方せん医薬品  
注意－医師等の処方せんにより  
使用すること

# 抗ウイルス化学療法剤

## ヴァイデックス錠25

## ヴァイデックス錠50

## ヴァイデックス錠100

VIDEX CHEWABLE/DISPERSIBLE  
BUFFERED TABLETS  
(ジダノシン錠)

### 【警告】

本剤の投与により肺炎があらわれることがあるので、血清アミラーゼ、血清リパーゼ、トリグリセライド等の生化学的検査を行うなど、患者の状態を十分に観察すること。

### 【禁忌(次の患者には投与しないこと)】

- (1) 肺炎の患者〔肺炎を増悪させることがある。〕
- (2) 本剤に対する過敏症の既往歴のある患者
- (3) テトラサイクリン系抗菌製剤，キノロン系抗菌製剤を投与中の患者(「相互作用」の項参照)

### 【原則禁忌(次の患者には投与しないことを原則とするが、特に必要とする場合には慎重に投与すること)】

妊婦又は妊娠している可能性のある婦人(「妊婦，産婦，授乳婦等への投与」の項参照)

### 【組成・性状】




#### 1. 組成

ヴァイデックス錠25，ヴァイデックス錠50，ヴァイデックス錠100は1錠(2.1g)中それぞれジダノシン25mg，50mg，100mgを含有する。

なお、添加物として水酸化マグネシウム，沈降炭酸カルシウム，アスパルテーム(L-フェニルアラニン化合物)，D-ソルビトール，クロスポビドン，香料，トコフェロール，ステアリン酸マグネシウム及び結晶セルロースを含有する。

#### 2. 製剤の性状

ヴァイデックス錠25，ヴァイデックス錠50，ヴァイデックス錠100は、微黄白色～淡橙色の円形の素錠で、橙色の斑点を認めることがある。かみくだいて水で服用するか、又は用時、水に懸濁して用いる錠剤である。

製 剤	外 観	直径 (mm)	厚さ (mm)	重さ (g)
ヴァイデックス錠 25		約19	約5	約2.1
ヴァイデックス錠 50		約19	約5	約2.1
ヴァイデックス錠 100		約19	約5	約2.1

### 【効能又は効果】

- ・後天性免疫不全症候群(エイズ)
- ・治療前のCD4リンパ球数500/mm<sup>3</sup>以下の症候性HIV感染症

### 【用法及び用量】

通常成人には、ジダノシンとして1回125mgを1日2回、12時間ごと食間に経口投与する。ただし、2カ月間効果が認められない場合、体重50kg以上の成人では1回200mgまで1日2回に増量できる。

通常小児(生後6カ月以上)には、ジダノシンとして下記の体表面積(体重)表により、1日2回、12時間ごと食間に経口投与する。

(小児用量)

体表面積(体重)	ジダノシン投与量
1.1～1.4m <sup>2</sup> (38～50kg)	1回100mg，1日2回
0.8～1.0m <sup>2</sup> (24～37kg)	1回75mg，1日2回
0.5～0.7m <sup>2</sup> (11～23kg)	1回50mg，1日2回
≤0.4m <sup>2</sup> (≤10kg)	1回25mg，1日2回

投与に際し、胃酸による効力の低下を防止するために成人及び体表面積(体重)が0.5m<sup>2</sup>(11kg)以上の小児には、2錠を組み合わせて指定の用量とする。また、体表面積(体重)が0.4m<sup>2</sup>(10kg)以下の小児には1錠を投与する。なお、症状により適宜増減する。

本剤はかみくだいて水で服用するか、又は用時、水に懸濁して服用する。

### 〈用法・用量に関連する使用上の注意〉

1. 本剤は水以外で調製しないこと。調製後は、使用時十分に振り混ぜること。また、やむをえず保存を必要とする場合は暗所に保存し、1時間以内に使用すること。
2. 本剤は水以外で服用しないこと。また、食事の影響により吸収率が約50%低下するので、食間に投与すること。
3. 本剤投与中、肺炎が認められた場合は、投与を中止すること。
4. 本剤と他の抗HIV薬との併用療法において、因果関係が特定できない重篤な副作用が発現し、治療の継続が困難であると判断された場合には、原則として本剤及び併用している他の抗HIV薬の投与をすべて一旦中止すること。

### 【使用上の注意】

#### 1. 慎重投与(次の患者には慎重に投与すること)

- (1) 肺炎の既往歴のある患者〔再発することがある。〕
- (2) 末梢神経障害又はその既往歴のある患者〔症状を増悪又は再発させることがあるので、減量、休薬若しくは中止を考慮すること。〕
- (3) 腎障害のある患者〔腎障害のある患者では、本剤の消失半減期が延長し、副作用が強くあらわれるおそれがあるので、投与量を調節するなど慎重に投与すること。〕
- (4) 肝障害のある患者〔肝障害を増強することがある。〕

#### 2. 重要な基本的注意

- (1) 本剤の使用に際しては、患者又はそれに代わる適切な者に、次の事項についてよく説明し同意を得た後、使用すること。
  - 1) 本剤はHIV感染症の根治療法薬ではないことから、日和見感染を含むHIV感染症の進展に伴う疾病を発症し続ける可能性があるため、本剤投与開始後の身体状況の変化については、すべて担当医に報告すること。

- 2) 本剤と相互作用を起こす薬剤があるかもしれないので、処方せんの有無にかかわらず服用している他の薬剤(ビタミン剤等を含む)をすべて担当医に報告すること。
- (2) 本剤の投与により**肺炎**があらわれ重篤な転帰をとることがあるので、血清アミラーゼ、血清リパーゼ、トリグリセライド等の生化学的検査を定期的に行うこと。これらの検査値の上昇がみられた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。また、腹痛、悪心・嘔吐等の臨床症状がみられた場合には、本剤の投与を中止し、生化学的検査(血清アミラーゼ、血清リパーゼ、トリグリセライド等)及び画像診断等による観察を十分に行うこと。
- (3) 本剤の投与により**末梢神経障害**があらわれることがあるので、末端のしびれ、刺痛感、四肢の疼痛等の症状が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- ※(4) 本剤の投与により、**乳酸アシドーシス、重度の脂肪肝を伴う肝腫、ときに重篤な肝障害、門脈圧亢進症(非肝硬変性も含む)**があらわれることがあるので、**定期的に検査**を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。なお、複数の妊婦において本剤とサニルブジンとの併用投与による致死性の乳酸アシドーシスが報告されているので、妊娠期間中の本剤とサニルブジンの併用投与は、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合のみ投与すること。
- (5) 本剤の大量投与により**網膜色素脱失**があらわれることがあるので、**定期的に視力検査**を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- (6) 本剤の投与により**高尿酸血症**があらわれることがあるので、著しい尿酸値の上昇が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- (7) 抗HIV薬の使用により、**体脂肪の再分布/蓄積**があらわれることがあるので、異常が認められた場合には適切な処置を行うこと。「その他の副作用」の項参照)
- (8) 本剤を含む抗HIV薬の多剤併用療法を行った患者で、免疫再構築症候群が報告されている。投与開始後、免疫機能が回復し、症候性のみならず無症候性日和見感染(マイコバクテリウムアビウムコンプレックス、サイトメガロウイルス、ニューモシスチス等によるもの)等に対する炎症反応が発現することがあるので、これらの炎症性の症状を評価し、必要時には適切な治療を考慮すること。

### 3. 相互作用

#### (1) 併用禁忌(併用しないこと)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
テトラサイクリン系抗菌剤 キノロン系抗菌剤	抗菌剤の効果が減弱されるおそれがある。	本剤にはマグネシウムを成分とするpH調節剤が含まれているため、マグネシウムとキレートを生成し、抗菌剤の吸収が低下する。

#### ※(2) 併用注意(併用に注意すること)

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ペンタミジン、アルコール、スルホンアミド、ザルシタピン、副腎皮質ステロイド剤	副作用を増強することがある。	これらの薬剤は副作用として肺炎が報告されている。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
ペンタミジン、アルコール、スルホンアミド、ザルシタピン、抗結核抗生物質、H <sub>2</sub> 受容体拮抗剤、サリドマイド	副作用を増強することがある。	これらの薬剤は副作用として末梢神経障害が報告されている。
胃内酸性度により吸収に影響を受ける薬剤(インジナビル硫酸塩エタノール付加物、リトナビル等)	本剤投与の2～2.5時間前に投与するなど投与間隔を適宜あけること。	本剤にはpH調節剤が含まれているため、胃内pHの上昇により、薬剤の吸収に影響を及ぼす。
アルミニウム又はマグネシウムを含む有する制酸剤	制酸剤の副作用を起こしやすくすることがある。	本剤にはpH調節剤が含まれているため制酸剤の副作用が増強される。
ガンシクロビル	副作用を増強することがある。定期的に血清アミラーゼ、血清リパーゼ、トリグリセライド等の生化学的検査を行い、これらの検査値の上昇が認められた場合には、本剤の減量若しくは投与を中止するなど適切な処置を行うこと。	本剤のAUCが111±114%(10～493%)増大したとの報告がある。
アロプリノール	副作用を増強することがある。	本剤のAUCが腎障害を有する患者において312%、健康成人において113%増大したとの報告がある。
リバビリン	肝不全、乳酸アシドーシス、肺炎等の副作用を増強する可能性がある。	<i>in vitro</i> において本剤のリン酸化を促進することが報告されている。
テノホビル ジソプロキシル fumarate	本剤の副作用を増強する可能性があるため、本剤の減量を考慮すること。また、抗HIV薬による治療経験のない高ウイルス量患者において、本剤を減量して併用した場合、効果の減弱が報告されている。	本剤のAUCとC <sub>max</sub> が上昇する。
アタザナビル硫酸塩	本剤200mgとアタザナビル400mgを同時に投与した場合にアタザナビルのAUCとC <sub>max</sub> が約1/10に低下するとの報告がある。本剤とアタザナビルを併用する場合は、アタザナビルを食事中又は食直後に投与後、2時間以上の間隔を空けて本剤を空腹時に投与すること。	本剤に処方されている緩衝剤により胃内のpHが上昇し、アタザナビルの吸収が抑制されるおそれがある。

### 4. 副作用

#### 副作用の概要(再審査終了時までの集計)

##### <国内の臨床試験>

総症例427例(承認時65例及び使用成績調査362例)における主な副作用及び臨床検査値異常は、下痢47例(11.0%)、アミラーゼ上昇31例(7.3%)、肝機能障害29例(6.8%)、嘔気23例(5.4%)、AST(GOT)の上昇19例(4.5%)、ALT(GPT)の上昇17例(4.0%)、食欲不振16例(3.8%)、しびれ(感)11例(2.6%)、肝障害及びγ-GTP上昇10例(2.3%)であった。

〈海外の臨床第Ⅰ/Ⅱ相試験(成人)〉

本剤が投与された170例のうち主な副作用は末梢神経障害(42%)、頭痛(32%)、下痢(29%)、悪心・嘔吐(25%)、発疹・痒痒感(25%)、無力症(24%)、不眠症(22%)、腹痛(22%)、肺炎(17%)、抑うつ(16%)、疼痛(16%)等であった。

〈米国拡大臨床試験(成人)〉

本剤が投与された7,806例のうち主な副作用は下痢(18%)、末梢神経障害(16%)、悪心・嘔吐(8%)、頭痛(5%)、腹痛(5%)、肺炎(5%)等であった。

〈米国臨床試験(小児)〉

本剤が投与された98例のうち主な副作用は咳(85%)、悪寒・発熱(82%)、下痢(81%)、発疹・痒痒症(70%)、悪心・嘔吐(58%)、頭痛(55%)、食欲不振(51%)等であった。

※〈海外の臨床試験 参考：カプセル剤の最終成績〉(ヴァイデックスECカプセル)

HIV感染症を対象とした比較臨床試験(AI454-152, -158)で、ジダノシンカプセル剤/サニルブジン/ネルフィナビル併用剤の安全性解析対象例324例中、289例(89.2%)に有害事象(薬剤の因果関係に関わりなく発現した症状)が認められ、その主な有害事象及び臨床検査値異常は、下痢(59.3%)、感染症(48.8%)、悪心・嘔吐(27.5%)、末梢神経障害(27.2%)、頭痛(20.1%)、無力症(18.2%)、発疹(17.6%)、腹痛(16.0%)、AST(GOT)の上昇(44.8%)、ALT(GPT)の上昇(42.2%)等であった。重篤な副作用として、薬剤(併用した3剤)に関連した肺炎が1例報告されている。

(1) 重大な副作用

- 1) **肺炎**(頻度不明)：肺炎があらわれることがあるので、血清アミラーゼ、血清リパーゼ、トリグリセライド等の生化学的検査を定期的に行うこと。これらの検査値の上昇がみられた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 2) **乳酸アシドーシス**(0.2%)：乳酸アシドーシスがあらわれることがあるので、このような場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

※※3) **肝障害、門脈圧亢進症(非肝硬変性も含む)**：重度の脂肪肝を伴う肝腫、重篤な肝障害(0.5%)、門脈圧亢進症(非肝硬変性も含む)(頻度不明)があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

- 4) **網膜色素脱失・視神経炎**(頻度不明)：網膜色素脱失・視神経炎があらわれることがあるので、このような場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 5) **発作・痙攣**(0.2%)、**錯乱**(頻度不明)：発作・痙攣、錯乱があらわれることがある。
- 6) **ミオパシー**(頻度不明)：ミオパシーがあらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 7) **低換気症**(頻度不明)：低換気症があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 8) **アナフィラキシー様反応**(頻度不明)：アナフィラキシー様反応があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 9) **皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)**(頻度不明)：皮膚粘膜眼症候群(Stevens-Johnson症候群)があらわれることがあるので、このような場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 10) **急性腎不全**(頻度不明)：急性腎不全があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 11) **汎血球減少症**(0.2%)：汎血球減少症があらわれることがあるので、定期的に検査を行うなど観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

- 12) **横紋筋融解**(頻度不明)：横紋筋融解があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。
- 13) **脳血管障害・脳出血**(頻度不明)：脳血管障害・脳出血があらわれることがあるので、このような場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

(2) その他の副作用

種類\頻度	5%以上又は頻度不明	1~5%未満	1%未満
精神神経系		末梢神経障害 <sup>(注)</sup> (末端のしびれ、刺痛感、四肢の疼痛等)	頭痛、不眠、抑うつ、疼痛、めまい、神経過敏、運動障害、嗜眠、不安感、緊張亢進、思考異常
消化器	下痢、悪心、血清アミラーゼ上昇	食欲不振	腹痛、嘔吐、便秘、口内炎、口渇、メレナ、食欲亢進、耳下腺腫大、唾液腺炎、消化不良、胃腸障害、鼓腸放屁、腹部膨満感
肝臓		AST(GOT)上昇、ALT(GPT)上昇、Al-P上昇、γ-GTP上昇	ビリルビン上昇
腎臓			頻尿、尿蛋白、尿潜血、血尿
循環器系			血管拡張、不整脈、血管炎、高血圧
血液		貧血、血小板減少	顆粒球減少、出血傾向、好酸球増多
全身症状		倦怠感	悪寒・発熱、無力症、体重減少、脱水症、インフルエンザ様症候群、全身浮腫
筋骨格			筋肉痛、関節炎、筋萎縮、筋力喪失
皮膚			発疹 <sup>(注)</sup> 、痒痒感 <sup>(注)</sup> 、紅斑 <sup>(注)</sup> 、湿疹、膿痂疹、脱毛
呼吸器			呼吸困難、喘息、うっ血、咳
代謝異常	体脂肪の再分布/蓄積(胸部、体幹部の脂肪増加、末梢部の脂肪減少、野牛肩)	尿酸上昇	糖尿病、低血糖、高血糖、CK(CPK)上昇、高脂血症
感覚器			味覚異常、耳痛、難聴、視力障害(羞明、斜視)、眼の乾燥
その他			成育不全

注)：発現した場合には、投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

5. 高齢者への投与

一般に高齢者では生理機能が低下しているため減量するなど注意すること。

6. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

(1) 妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。[複数の妊婦において本剤とサニルブジンとの併用投与による致死性の乳酸アシドーシスが報告されている。]

- (2) 授乳婦に投与する場合には、授乳を中止させること。[動物実験(ラット)で、乳汁中に移行することが報告されている。]

## 7. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児(6カ月未満)に対する安全性は確立していない。(使用経験がない)

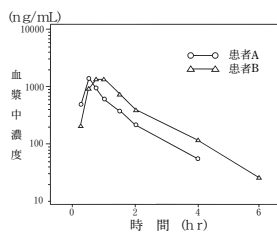
## 8. その他の注意

- (1) 本剤は胃酸で分解されるため、製剤にはpH調節剤及び緩衝剤が含まれている。
- (2) 変異原性試験(突然変異試験、染色体異常試験、形質転換試験)では、変異原性が陽性であった。
- (3) マウス、ラットへの90日以上投与では、骨格筋に対する毒性が認められているが、ヒトでのミオパシーとの関連性は明らかでない。
- (4) 本剤とヒドロキシウレアが併用されたHIV感染患者で、死亡を含む重篤な膵炎、肝障害及び高度の末梢神経障害が発現したとの報告がある。

## 【薬物動態】

### 日本人による成績<sup>1)</sup>

症候性HIV感染症患者2例にドライシロップ167mgを経口投与した時の最高血漿中濃度は0.63時間後に1,362ng/mLを示し、血漿中半減期は約1時間であった。

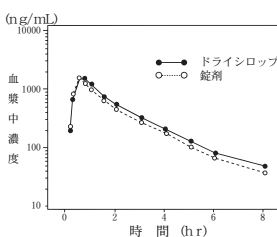


### (参考)外国人による成績<sup>2),3)</sup>

エイズ又はエイズ関連症候群(ARC)患者にドライシロップ375mg及び錠剤300mg(150mg×2)を経口投与した時の最高血漿中濃度はそれぞれ1,595及び1,628ng/mLを示し、血漿中半減期は両製剤とも約1.7時間であった。また、12時間までの平均尿中回収率は、両製剤とも未変化体として約21%であった。錠剤300mg(150mg×2)投与時の生物学的利用率は、ドライシロップ375mg投与時の生物学的利用率と同等であると推定された。

なお、小児患者にジダノシンとして40~180mg/m<sup>2</sup>を経口又は静脈内投与した成績では、投与0.5~3.5時間後における髄液中/血漿中濃度比は0~0.85であったとの報告がある。

ジダノシンのヒト血清蛋白結合率は3.4%以下であった。



## 【臨床成績】<sup>1)</sup>

日本国内における臨床試験は、エイズ及びエイズ関連症候群(ARC)及びCD4陽性リンパ球数200cells/ $\mu$ L以下の無症候性HIV感染症(AC)と診断された70例を対象に実施された。

米国における臨床試験は、エイズ及びエイズ関連症候群(ARC)の成人患者170例を対象に実施され、小児患者については98例を対象に実施された。これらの米国での結果に基づき、拡大臨床試験が海外で開始され、米国では7,806例、英国では105例及び仏国では103例を対象に本剤が投与された。その結果、本剤のHIV感染者に対する臨床上の有用性が確認された。

### 臨床試験成績1.

日本国内における臨床試験成績は、ACを除く評価可能な51例を対象に検討し、51.0%(26/51)に改善が認められた。なお、本剤の効果は、検査可能な症例を対象に種々の反応が最低4週間維持されていることを前提として判定した。

その結果、CD4陽性リンパ球数増加(50%又は50cells/ $\mu$ L増加)は40.8%(20/49)、p24抗原量減少(陰性化又は50%以下に減少)は61.1%(11/18)、体重増加(2.5kg以上又は体重25kg未満では10%以上増加)は17.1%(7/41)、及び自覚症状の改善は76.6%(36/47)であった。

### 臨床試験成績2.(参考:外国人による成績)

海外の臨床試験の中で、米国での成績を以下に示す。なお、本剤の効果は、国内と同様に判定した。その結果、170例の症候性HIV感染症の患者に対してはCD4陽性リンパ球数増加(50%かつ50cells/ $\mu$ L増加)は22.0%、p24抗原量減少(陰性化又は50%以下に減少)は61.4%、体重増加(2.5kg以上又は体重25kg未満では10%以上増加)は38.6%、及び自覚症状の改善は45.6%であった。また、小児に対する効果は症候性HIV感染症の患者89例を対象に検討した。その結果、CD4陽性リンパ球数増加は22.9%、p24抗原量減少は73.5%、及び体重増加は38.6%であった。

## ※【薬効薬理】

### 1. 作用機序<sup>1),5)</sup>

ジダノシンは天然ヌクレオシドであるデオキシアデノシンの3位水酸基を水素に置換した合成ヌクレオシド誘導体である。細胞内において細胞性酵素により活性化代謝物のジデオキシアデノシン5'-三リン酸に変換される。ジデオキシアデノシン5'-三リン酸は、天然基質のデオキシアデノシン5'-三リン酸との競合により、またウイルスDNAに取り込まれることによりウイルスDNA鎖の伸長を停止させ、HIV-1の逆転写酵素活性を阻害する。

### 2. 細胞培養アッセイにおける抗ウイルス活性<sup>6)</sup>

各種HIV-1感染リンパ芽球性細胞及び単球/マクロファージ細胞を用いて、ジダノシンの抗HIV-1活性を検討した。その結果、ジダノシンのウイルス複製の50%阻害濃度(EC<sub>50</sub>値)は、リンパ芽球性細胞で2.5~10 $\mu$ M及び単球/マクロファージ細胞で0.01~0.1 $\mu$ Mであった(1 $\mu$ Mは0.24 $\mu$ g/mLに相当)。

### 3. 耐性<sup>6)</sup>

ジダノシンに対して低感受性のHIV-1分離株が*in vitro*で選択されたほか、ジダノシン投与患者からも分離されている。ジダノシン投与患者の分離株の解析では、アミノ酸をコードしている遺伝子の点突然変異による、逆転写酵素の65番目のアミノ酸がリジンからアルギニンへ、74番目のアミノ酸がロイシンからバリンへ、また184番目のアミノ酸のメチオニンからバリンへの置換が確認された。臨床分離株では74番目のアミノ酸のロイシンからバリンへの置換が最も頻りに観察された。ジダノシンを6~24カ月単独投与した患者60例(ジドブジンの投与を受けたことのある患者を含む)から採取したジダノシン誘発突然変異をもつHIV-1分離株のジダノシンに対する感受性を*in vitro*で検討した結果、感受性が1/10に低下した患者が10例観察された。ジダノシン感受性の低下した臨床分離株は、1つ若しくはそれ以上のジダノシン耐性関連の置換を有していた。

### 4. 交差耐性<sup>6)</sup>

2年以上にわたりジダノシンとジドブジンの併用療法を受けた患者39例中2例から分離されたHIV-1分離株の感受性を*in vitro*で検討した結果、ジドブジン、ジダノシン、ザルシタピン、サニルブジン及びラミブジンに対して感受性が低下していた(交差耐性を示した)。これらの分離株の解析では、アミノ酸をコードしている遺伝子の点突然変異による、逆転写酵素の62番目のアミノ酸がアラニンからバリンへ、75番目のアミノ酸がバリンからイソロイシンへ、77番目のアミノ酸がフェニルアラニンからロイシンへ、116番目のアミノ酸がフェニルアラニンからチロシンへ、また151番目のアミノ酸がグルタミンからメチオニンへと5ヵ所の置換が確認された。臨床試験の結果より、チミジン誘導体によるアミノ酸置換(41番目のメチオニンがロイシン、67番目のアスパラギン酸がアスパラギン、210番目のロイシンがトリプトファン、215番目のスレオニンがチロシン、219番目のリジンがグルタミン)が存在する場合にはジダノシンに対する感受性が低下することが示された。

## 【有効成分に関する理化学的知見】

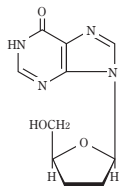
一般名：ジダノシン(didanosine)

化学名：(-)-2',3'-ジデオキシイノシン

分子式：C<sub>10</sub>H<sub>12</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>

分子量：236.23

構造式：



性状：ジダノシンは白色～微黄白色の結晶性の粉末である。水にやや溶けにくく、エタノール(95)に極めて溶けにくい。

## 【包装】

ヴァイデックス錠25：60錠(瓶入)

ヴァイデックス錠50：60錠(瓶入)

ヴァイデックス錠100：60錠(瓶入)

## 【主要文献及び文献請求先】

### 主要文献

- 1) 山田兼雄ほか：臨床とウイルス，20(4)，253(1992)
- 2) Knupp, C. A.：社内資料
- 3) Shyu, W. C. et al.：社内資料
- 4) Yarchoan R, et al. Clinical pharmacology of 3'-azido-2'-3'-dideoxythymidine (Zidovudine) and related dideoxynucleosides. *N Engl J Med* ; 321(11) : 726-738 (1989)
- 5) McGowan JJ, et al. Overview of the preclinical development of an antiretroviral drug, 2'-3'-dideoxyinosine. *Rev Infect Dis* ; 12(suppl. 5) : S513-521 (1990)
- 6) ヴァイデックスECカプセル米国添付文書

### 文献請求先

ブリistol・マイヤーズ株式会社

メディカル情報部

(住所) 東京都新宿区西新宿6-5-1

(TEL) 0120-093-507



弊社では、本剤のほかにヴァイデックスECカプセル125、ヴァイデックスECカプセル200 [それぞれ1カプセル中125mg, 200mg含有] を販売致しております。



製造  
販売元

ブリistol・マイヤーズ株式会社  
東京都新宿区西新宿6-5-1

